

⑩ 日本国特許庁(JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報(A) 平3-5423

⑬ Int. Cl.³

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 平成3年(1991)1月11日

A 61 K 31/35
7/00

ADN

D
F
X
K7475-4C
8413-4C
8413-4C
8413-4C
8413-4C
8314-4C
7329-4B
7375-4C// A 23 L 7/06
3/3472
C 07 D 311/30

審査請求 未請求 請求項の数 1 (全5頁)

⑮ 発明の名称 フラボノイド含有過酸化脂質生成抑制剤

⑯ 特 願 平1-140861

⑰ 出 願 平1(1989)6月1日

⑱ 発 明 者 小 島 弘 之 岐阜県各務原市下中屋町2丁目224番地
 ⑲ 発 明 者 安 藤 裕 岐阜県大垣市三塚町998番地
 ⑳ 発 明 者 松 井 達 次 岐阜県岐阜市加野1677番地7号
 ㉑ 発 明 者 坪 井 誠 岐阜県大垣市宮町1丁目25番地
 ㉒ 出 願 人 一丸ファルコス株式会 岐阜県山県郡高富町高宮337番地
 社

明 細 書

1. 発明の名称

フラボノイド含有過酸化脂質生成抑制剤

2. 特許請求の範囲

(1)

フラボノイドとして、モリン、クリシン、オク
 ブニン、ロイホリン、ヘスペレチン、ネオヘスペ
 リジン、ジオカニンA、フェラムリン、アムフェ
 ロールの内、その1種又は1種以上を含有するか
 又は、上記フラボノイドの1種、又は1種以上を
 含有する、植物エキスを含有することを特徴とする、
 過酸化脂質生成抑制剤。

3. 発明の詳細な説明

(イ) 発明の目的

本発明は、過酸化脂質生成抑制剤の新規な開発
 に関する。

「産業上の利用分野」

本発明は、特定されたフラボノイド、又は特定
 されたフラボノイドを含む、植物抽出エキスをも
 って、過酸化脂質の生成抑制剤となす。

その応用分野としては、例えば、化粧水又はク
 リーム、乳液、その他の剤形の肌や頭髮に使用さ
 れる、化粧品中に配合して用いることが出来る。

又、飲料として、あるいは加工食品などに配合
 して用いることが出来る。

本発明によるフラボノイド、又はそれを含む植
 物抽出エキスを処方中に配合することにより、処
 方中に含まれた脂質成分の酸化を防ぎ、安定化に
 寄与するとともに、これを塗布すれば、肌や毛髪
 組織内の脂質、更に、服用(飲用)すれば、体内
 の過酸化脂質の異常な高まりによって起こる、種
 々な症状の改善効果が期待出来る。

「従来の技術」

フラボノイドを化粧品や加工食品、あるいは
 医薬品等の分野に応用する試みは、古くから行な
 われてきているが、フラボノイドをもとに、過酸
 化脂質生成抑制剤として、実際に利用するに至っ
 たのは、ごく最近のことである。

生体における脂質の過剰な酸化の荒んだ状態では、
 肝機能障害、高尿酸症、動脈硬化症などの引き

特開平3-5423(2)

金になっていると考えられている。又、肌や毛髪において、過酸化脂質の反応範囲内や皮層分泌量の増加が長期間にわたれば、正常な肌や毛髪の成長を妨げ、フケ、カユミ、肌荒れ、脱毛、シラガなど、いわゆる老化現象を促進し、更に肌では色素メラニンの沈着による、シミの発生を促進する原因となっているとも考えられ、これらの点は、組織細胞学的な角度、臨床学的な角度から、相次ぎ確認されるに至り、このことがナカキ台となつて、従来な過酸化脂質に対する生成抑制剤の開発へと発展して来ている。

そして、過酸化脂質の生成反応の主要部についてみれば、それは、ラジカル反応であるといふ。フェノール類であるフラボノイドは、ラジカルの有効な消滅・除去剤として注目されるに至つたのであるが、しかしながら、すべてのフラボノイドについて、その効果〔作用〕があるとはいえず、ある種の特定されたものに用いられている。(公知刊行物の所見)

フラボノイド系天然抗酸化剤について

グ)。

2: その取率(収量)性。

3: そして、同時に安定性が悪いものでは、利用(配合)上、好ましくはない。

以上、3つの条件を満たすことが可能な抽出物が発見できたならば、それは本発明の目的が達成される。

しかし、上記した3つの条件について、満足するものとなると、それは極めて少なかった。

(ロ) 発明の構成

本発明は、次に示す植物由来のフラボノイド、又はそれらを含む植物エキスをもち、過酸化脂質抑制剤となす。

セリン: *seirin*、クリシン: *chrysin*、オウゴン: *oogonin*、ロイホリン: *rhoifolin*、ヘスペレチン: *hesperetin*、ネオヘスペリジン: *neo hesperidin*、バイオニンA: *biochanin A*、フェラムリン: *phellaurin*、ケムフェロール: *kaempferol*、

「課題を解決するための手段」

書名: 野野 花/ニューフードイングストリー
Vol. 30, No. 12 p. 38~43

発行日: 昭和63年12月1日(1988年)

発行所: 陶食品質研究会

「発明が解決しようとする課題」

本発明者は、天然産物の有効利用をテーマとし、各種の植物組織中から、過酸化脂質に対する生成抑制作用を有する物質の検索をもとに、新規な過酸化脂質に対する抑制剤の開発を課題となす。

すなわち、植物のみならず、動物、微生物などのあらゆる生物の習性において、過酸化脂質の生成を抑制する物質は、その強弱の差はあっても、必ず存在するといつても過言ではない。

従つて、本発明における解決すべき課題点としては、次の如くの点を把握し、より優れた過酸化脂質抑制剤の開発に当ることにある。

1: 先ず第1が過酸化脂質作用の測定方法をもちにして、その作用の強弱について、多種多様の植物組織(出発原料)からの検査(スクリーニング)。

本発明は植物中に含まれる各種フラボノイドから、過酸化脂質の生成に対して、その抑制効果に優れた公知フラボノイドの選抜と共に、新たな抑制剤となりうるフラボノイドの検索試験に当り、その成績結果をもとに、新規なフラボノイド、あるいは、新規なフラボノイドを含む植物抽出エキスをもち、過酸化脂質の抑制剤となし、利用することを目的とするため、先ず、本発明を解決するに際して、以下に示す試験法により、検索を実施した。

その結果、ケムフェロール: *kaempferol*、ケニステイン: quercetin、セリン: *seirin*、アピゲニン: apigenin、クリシン: *chrysin*、オウゴン: *oogonin*、ヘスペレチン: *hesperetin*、ロイホリン: *rhoifolin*、ケルセチリン: quercitrin、ネオヘスペリジン: *neohesperidin*、バイオニンA: *biochanin A*、フェラムリン: *phellaurin*、ゲニスチン: genistein、ヘスペリジン: hesperidin、オウゴン: oogonin、ダイゼリン: daizein、又はこれらを含む植物抽

特開平3-5423(3)

出エキスについては、著明な過酸化脂質の抑制作用があることを確認するに至った。

但し、本発明では、上記のアンダーラインをしたフラボノイドについては、測定したところの抑制率などにおいて、すでに、開示又は示唆されており除外される。

「過酸化脂質生成抑制作用/効果の確認」

(A) 試験方法

本発明における作用/効果の確認には、次の如くの実験条件下で実施した。

0.8%ラウリル硫酸ナトリウム水溶液に0.1%リノレン酸を加えて溶解し、次に、この溶液を3.9mL取り、これに過酸化液にした各種の脂化物質類「検体」を、0.1mL加入した後、その溶液に対して、紫外線（高圧水銀ランプ：FL-20SEランプ、FL-20SB（L）ランプを、それぞれ3灯並列（照射距離：30cm）して、1時間照射した。この液を1mL取り、次に、0.8%チオバルビツール酸（TBA）水溶液1.5mLと20%酢酸（pH3.5）1.5mL

を加えた後、35℃で1時間加熱する。冷却、精製水1mL及びα-ブタノール：ピリジン（15：1）5mLを加えて、よく振り、通心分液瓶にかけて、α-ブタノール層の532nmの吸光度を測定して、生成された過酸化脂質の量を測定する方法により実施した。

尚、測定法については、検体を加えて紫外線を照射した場合の過酸化脂質量をa、検体を加えて紫外線を照射しない場合の過酸化脂質量をb、検体を加えないで紫外線を照射した場合の過酸化脂質量をc、検体を加えないで紫外線を照射しない場合の過酸化脂質量をdとし、 $a-b$ 及び $a'-b'$ を過酸化脂質生成量として、次式をもって、それぞれの検体の抑制率を求めた。

$$\text{抑制率}(\%) = \left[1 - \frac{a-b}{a'-b'} \right] \times 100$$

本発明において採用した方法は、一般的には、TBA法と呼ばれている定量法であるも、詳細については、次の文献に示されている。

(測定法に関する文献所在)

アナリテカル バイオケミストリー Vol.35, p.351~358, (1979年)

(D) 効果/過酸化脂質生成抑制作用

上記試験法をもとに、多くの植物成分（エキスを含む）の中から、検出された結果、本発明では前記したフラボノイドを特定することが出来たのである。

次表「表1」は、本発明及び公知の過酸化脂質の生成抑制物質に係る、フラボノイドについて、前記(A)の試験法を用いて、その系中に添加する濃度を、20μg、10μgにより測定したときの成績結果である。

本発明で特定したフラボノイドは、いずれも極めて微量の濃度で、特に、過酸化脂質の生成に対して、強く抑制作用を有することが確認出来たのである。

「表1」過酸化脂質生成抑制作用

検体/添加量	抑制率(%)	
	20μg	10μg
セリン	96.1	89.6
クリシン	70.3	59.4
オウゴン	67.9	56.5
ロイボリン	69.2	51.6
ヘスペレチン	70.5	54.2
ネオヘスペリジン	56.2	41.5
ビオカニンA	62.8	51.2
フェラムリン	59.9	45.2
ケムフェロール	85.4	74.2
公知過酸化脂質生成抑制物質	クエルセチン	86.0
	アビゲニン	75.6
	クエルシトリン	73.6
	ヘスペリジン	49.7
	ナリングニン	44.3
	ダイゼイン	15.3
ゲニステイン	49.7	22.6

上記、表1に示される新規な過酸化脂質に対するフラボノイドの構造は、表2に示すごとくである。

